

COMPOSICIÓN:

Cada cápsula contiene:

Orlistat.....120 mg

Excipientes, c.s.p.....1 Cápsula

DESCRIPCIÓN:

Enlalínea® cápsulas contiene orlistat, también conocido como tetrahidrolipstatin, un fármaco utilizado para tratar la obesidad mediante la inhibición potente, selectiva y reversible de las lipasas gástricas y pancreáticas.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

Enlalínea® cápsulas está indicada como tratamiento a largo plazo de pacientes obesos o con sobrepeso (junto con una dieta hipocalórica), incluidos los que presentan factores de riesgo asociados a la obesidad, como aquellos pacientes con diabetes tipo II que reciben tratamiento antidiabético.

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:

El orlistat muestra una absorción sistémica mínima. Los niveles plasmáticos máximos se observan a las 8 horas después de una dosis de 360 mg. En los estudios clínicos se han observado consistentemente niveles plasmáticos muy bajos del fármaco sin que se produjera acumulación. Los efectos del fármaco se mantienen entre las 24 y 48 horas. In vitro, el orlistat se une en > 99% a las proteínas del plasma. El orlistat se metaboliza en el intestino a metabolitos inactivos o casi inactivos y el 83% de la dosis se excreta sin alterar. La eliminación renal es inferior al 2% de la dosis. La semivida de eliminación de la porción absorbida del orlistat es de 1-32 horas.

El orlistat es un potente inhibidor específico y reversible, de acción prolongada, de las lipasas gastrointestinales. Ejerce su actividad terapéutica en el lumen del estómago y el intestino delgado, formando una unión covalente con la serina, en el sitio activo de las lipasas gástricas y pancreáticas. La enzima inactivada es por lo tanto, incapaz de hidrolizar los triglicéridos de la dieta en ácidos grasos libres y monoglicéridos absorbibles.

REACCIONES ADVERSAS:

El orlistat es un fármaco seguro y usualmente bien tolerado. Los principales eventos adversos reportados son gastrointestinales: flatulencia, distensión abdominal, malestar abdominal, urgencia fecal, incontinencia fecal, flatulencia, heces grasas u oleosas, incremento en las deposiciones. Estos eventos adversos pueden reducirse limitando la ingesta de grasas en la dieta.

Otros eventos adversos reportados son: heces blandas o líquidas, diarrea, dolor abdominal, cefalea, dolor o sensación de malestar rectal, ansiedad, mareos, fatiga, irregularidad menstrual, náuseas, vómito, mialgias y/o artralgiás, reacciones alérgicas (incluyendo rash cutáneo, exantema, urticaria, angioedema, broncoespasmo, erupción bullosa, anafilaxia), trastornos dentarios y/o gingivales, coledocistitis, dolor torácico, pancreatitis, fisura anal, hipoglicemia (principalmente en pacientes diabéticos tipo II), elevación de transaminasas y/o fosfatasa alcalina, hepatitis (se han reportado algunos casos de alteraciones hepáticas, incluyendo casos graves o severos, aunque no se ha podido confirmar una relación causa-efecto); de todas maneras, se recomienda advertir al paciente al respecto y explicar los signos de alarma.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

En ensayos clínicos, la disminución de peso producida por el tratamiento con orlistat fue menor en pacientes con diabetes tipo II que en pacientes no diabéticos. El tratamiento antidiabético debe estar estrechamente monitorizado cuando se administre orlistat. No se recomienda la administración conjunta de orlistat con ciclosporina. Se debe aconsejar a los pacientes que sigan las recomendaciones dietéticas que les sean dadas. Si el orlistat se toma con una dieta rica en grasas (p.ej., en una dieta de 2,000 kcal/día, > 30% de las calorías provenientes de grasas equivale a > 67 g de grasa) puede aumentar la posibilidad de sufrir reacciones adversas gastrointestinales. La ingesta diaria de grasa debe distribuirse entre las tres comidas principales.

En los pacientes tratados concomitantemente con anticoagulantes orales, se deben monitorizar los parámetros de coagulación. El uso de orlistat puede estar asociado con hiperoxaluria y nefropatía por oxalato que en ocasiones puede conducir a una insuficiencia renal. Este riesgo se incrementa en pacientes con nefropatía crónica subyacente y/o hipovolemia. De forma rara se pueden producir casos de hipotiroidismo y/o alteraciones del control del hipotiroidismo. El mecanismo, aunque no se ha comprobado, puede deberse a una disminución en la absorción de sales de yodo y/o levotiroxina. Pacientes tratados con antiepilépticos: orlistat puede alterar el tratamiento anticonvulsivo al disminuir la absorción de los fármacos antiepilépticos, lo que puede llevar a la aparición de convulsiones. Antirretrovirales para el VIH: orlistat potencialmente puede disminuir la absorción de los medicamentos antirretrovirales contra el VIH y podría afectar negativamente a la eficacia de los medicamentos antirretrovirales contra el VIH.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al orlistat o a cualquiera de los componentes del medicamento, y en aquellos pacientes con síndrome de malabsorción crónica o colestasis. No se disponen de estudios adecuados sobre la seguridad del orlistat durante el embara-

zo y la lactancia, razón por la cual se debe evitar su uso en estas situaciones.

INTERACCIONES:

El orlistat puede reducir la absorción de las vitaminas liposolubles A, D, E, K y beta caroteno. En pacientes que toman warfarina y otros anticoagulantes el índice internacional normalizado (INR) debe monitorizarse durante el tratamiento con orlistat.

Se ha registrado una reducción de concentraciones de ciclosporina a niveles subterapéuticos en receptores de trasplantes después de la administración simultánea de orlistat. La interferencia es de importancia clínica debido a que la reducción de ciclosporina en sus concentraciones plasmáticas puede inducir un rechazo agudo del trasplante.

Los pacientes que reciben tratamiento con anticonvulsivantes lipofílicos (lamotrigina, ácido valproico, vigabatrina, gabapentina) conjuntamente con orlistat, deben ser monitoreados ya que pueden presentarse alteraciones en las concentraciones séricas de éstos.

Se recomienda que durante el tratamiento con orlistat no se administre acarbosa. La administración oral de amiodarona durante el tratamiento con orlistat demostró una reducción del 25 al 30% en la exposición sistémica a la amiodarona y desetilamiodarona.

El orlistat puede interferir la absorción intestinal de tiroxina en pacientes bajo tratamiento con esta hormona.

En pacientes tratados con medicamentos antidiabéticos (sulfonilureas, metformina) se requiere un control regular de la glicemia y ajuste de las dosis para evitar posibles episodios de hipoglucemia.

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:

El orlistat se clasifica dentro de la categoría X de riesgo en el embarazo. El orlistat no está recomendado durante el embarazo ya que no existen estudios clínicos controlados en mujeres gestantes. En los animales de experimentación, dosis orales de orlistat de hasta 800 mg/kg/día no indujeron teratogenia ni embriotoxicidad. Sin embargo, los estudios en animales no siempre son predictivos de la respuesta humana.

El orlistat no debe ser administrado a mujeres durante la lactancia ya que se desconoce si el fármaco se excreta en la leche materna.

SOBREDOSIFICACIÓN Y TRATAMIENTO:

Se han estudiado en individuos con peso normal y obeso, dosis únicas de 800 mg y múltiples de hasta 400 mg tres veces al día durante 15 días, sin que hubiera hallazgos adversos significativos.

Además, se han administrado dosis de 240 mg tres veces al día durante 6 meses a pacientes obesos. En la mayoría de los casos de sobredosis con orlistat notificados tras la comercialización no hubo reacciones adversas o las observadas eran similares a las descritas con la dosis recomendada. En caso de sobredosis importante de orlistat, se recomienda observar al paciente durante 24 horas. Según los estudios realizados con humanos y animales, cualquier efecto sistémico atribuible a la capacidad del orlistat de inhibir las lipasas debe ser rápidamente reversible.

DOSIFICACIÓN Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Vía de administración: oral.

Adultos: la dosis recomendada de **Enlalínea® cápsulas** es de una cápsula de 120 mg administrada con agua inmediatamente antes, durante o hasta una hora después de cada comida principal.

En caso de omitir una comida o que la comida no contenga grasa, se puede omitir la dosis de **Enlalínea® cápsulas**. El paciente debe seguir una dieta nutricionalmente equilibrada, moderadamente hipocalórica, con aproximadamente el 30 % de las calorías provenientes de las grasas.

Se recomienda que la dieta sea rica en frutas y verduras. La ingesta diaria de grasa, carbohidratos y proteínas debe distribuirse entre las tres comidas principales. Las dosis de **Enlalínea® cápsulas** superiores a 120 mg tres veces al día no han demostrado un beneficio adicional.

PRESENTACIONES:

Caja conteniendo 3 blísteres con 10 cápsulas.

Caja conteniendo 10 blísteres con 10 cápsulas

LEYENDAS DE PROTECCIÓN:

Venta por receta médica.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Consérvese en un lugar fresco y seco entre 25 – 30 °C.



Fabricante y Titular:

LABORATORIO LAPROFAR, S.R.L.
C/2da. Av. Los Restauradores No.1,
Sabana Perdida, Santo Domingo Norte.